

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 62-148416

(43)Date of publication of application : 02.07.1987

---

(51)Int.Cl.

A61K 7/06

---

(21)Application number : 60-291054

(71)Applicant : KANEBO LTD

(22)Date of filing : 23.12.1985

(72)Inventor : MOTOI TOSHIYUKI

---

## (54) HAIR TONIC

### (57)Abstract:

PURPOSE: A hair tonic, containing 2,4-diamino-6-piperidino-pyrimidine-3-oxide ad oxendolone, capable of exhibiting remarkably good hair growth promoting effect, stable even in preservation for a long period and having improved effect on inhibition of dandruff and itching.

CONSTITUTION: A hair tonic containing (A) 2,4-diamino-6-piperidino-pyrimidine-3- oxide and (B) oxendolone (16 $\beta$ -ethyl-17 $\beta$ -hydroxy-4-estren-3-one) at 25:0.1W1:1 weight ratio of the ingredients (A) to (B). The amouts of the ingredients (A) and (B) based on the total weight of the hair tonic are as follows; 0.05W5wt% ingredient (A) and 0.005W0.5wt% ingredient (B). The above-mentioned hair tonic is capable of exhibiting effect, e.g. remarkable promotion of hair growth, conversion of live hair into rigid hair, prevention of depilation, suppression of sebum secretion, inhibition of dandruff formation, etc. The hair tonic is formulated into a dosage form, e.g. hair tonic, hair lotion, hair cream, etc., according to a conventional method.

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭62-148416

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和62年(1987)7月2日

A 61 K 7/06

7417-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 養毛料

⑯ 特 願 昭60-291054

⑰ 出 願 昭60(1985)12月23日

⑱ 発 明 者 元 井 利 幸 小田原市高田大字北ノ前139番地の6

⑲ 出 願 人 縫 紡 株 式 会 社 東京都墨田区墨田5丁目17番4号

明 細 書

1. 発明の名称

養毛料

2. 特許請求の範囲

2,4-ジアミノ-6-ピペリジノ-ピリミジン-8-オキサイドとオキセンドロンとを含有することを特徴とする養毛料。

3. 発明の即柄な説明

(産業上の利用分野)

本発明は、2,4-ジアミノ-6-ピペリジノ-ピリミジン-8-オキサイドとオキセンドロンとを含有することを特徴とする養毛料に関する。

(従来の技術)

脱毛症には数多くの薬剤がその治療に応用されている。即ち、頭皮の血行を促進したり、毛母細胞を活性化したり、毛髪の栄養成分であるアミノ酸やビタミン類を配合する例が多い。また、最近では、男性ホルモン過剰に起因する性ホルモンのアンバランスが脱毛症の原因であるとの説がたてられ、その阻害に基づく抗男性ホルモン剤を配合

する養毛料が考案されている。

しかしながら、これらの養毛料によっては、充分な効果は得られていないのが現状である。

(発明が解決しようとする課題)

本発明者等は脱毛症の原因は性ホルモンのアンバランスのみに起因するのではなく、血行の不全や毛母細胞活性の低下等も同時に原因として存在していると考え、前述の数多くの薬剤及びそれらの組合せについて鋭意研究した結果、2,4-ジアミノ-6-ピペリジノ-ピリミジン-8-オキサイドとオキセンドロンとを含有した養毛料が、

(1) 著しく毛成長を促進すること、

(2) 生毛が剃毛化すること、

(3) 脱毛を予防すること、

(4) 皮脂の分泌を抑制すること、

(5) ふけの生成を抑制すること等を見出し、本発明を完成した。

(課題点を解決するための手段)

即ち、本発明は、2,4-ジアミノ-6-ピペリ

ジノ-ピリミジン-8-オキサイトとオキセンドロンとを含有することを特徴とする養毛料である。

2,4-ジアミノ-6-ピペリジノ-ピリミジン-8-オキサイドは公知の物質で(usp 2461461 usp 4,189,819), 別名6-アミノ-1,2-ジヒドロ-1-ヒドロキシ-2-イミノ-4-ピペリジノピリミジンである。以下、化合物Aと略記する。

オキセンドロンは化学名が1 $\beta$ -エチル-17 $\beta$ -ヒドロキシ-4-エストレン-3-オンで公知の物質である(特開昭58-162512)。

本発明の養毛料に配合される化合物Aの配合量は、組成物の全重量に対して通常0.05~5重量%である。

一方、オキセンドロンの配合量は通常0.005~0.5重量%である。そして、化合物Aとオキセンドロンとは25:0.1~1:1の組成割合で含有されていることが好ましい。

本発明の養毛料は、常法に従って、ヘアートニック、ヘアローション、ヘアークリーム等の所

型に調製することが可能である。本発明の養毛料における基剤としては、例えば水、エタノール等のアルコール類、グリセリン等の多価アルコール類、流動パラフィン、高級脂肪族(ステアリン酸等)、脂肪族グリセライド(グリセリンモノステアレート等)、高級アルコール、動植物油、ワックス類等の油性物質、界面活性剤(乳化剤、可溶化剤)、殺菌剤、防腐剤等を適宜配合し得る。

#### (発明の効果)

本発明の養毛料は、ヒトまたは動物の皮膚に塗布すると顕著良好な毛成長促進効果(養毛効果)を発揮し、かつ長期保存しても安定であって、その商品価値は極めて高い。また、ゆけ、かゆみを抑制する効果にも優れた効果を発揮する。

更に後記実施例で示すように、本発明の養毛料は非常に低濃度配合にても効果を発揮するという特徴を有する。この事は、薬剤の少量使用による副作用発現の観点よりみて非常に有用である。

公知の養毛剤の中から、本発明の組み合わせが特に顕著な効果を発揮するメカニズムについては、

明確ではないが、両化合物の効果が相補的・相乗的に増大したものと考えられる。

#### (実施例)

以下、実施例、比較例の記載に基づいて本発明を詳説する。また、白色マウスに対する毛成長促進効果、ヒト頭皮に対する毛成長促進効果等の試験方法を下記に示す。

##### (1) マウス毛成長促進効果試験方法

6dY系白色マウス(雄、6週齢、平均体重85g)の尾部よりの背部皮膚を電気バリカンで刈った後、脱毛クリームにより完全に除毛し、翌日より実施例及び比較例の各試料を被験部皮膚に毎日朝夕2回、一匹当たり0.1mlを塗布した。一試料に対して動物は一群10匹使用した。養毛効果の判定は、第1表に示す判定基準による肉眼判定の評価点と毛長、毛重量を比較例と比較することにより行った。

実験開始後15日目に動物を屠殺し第1表に示す判定基準により肉眼判定し、その評価点を合計し、一匹当たりの平均評価点を求めた。さらに、

被験部の皮膚を切除し、直径1.8cmのパンテで、一定面積の皮膚を打ち抜いて、乾燥後毛の重量を測定し、その中の20本の毛の長さについても測定し、平均値を算出した。

第1表 養毛効果の評価点の判定基準

評価点	判 定 基 準
6	周囲の非被毛部との境界が不明
4	毛成長高度
3	毛成長中等度
2	毛成長低度
1	毛成長極く低度
0	毛成長認められず

##### (2) ヒト頭皮養毛成長促進効果試験方法

所定人数の被験者の頭部の耳の上5cmの位置の頭皮を左右2ヶ所を直径1cm剃毛した被験部位に試料を左側に、対照例を右側と定めて毎日朝夕2回、約3ml塗布した。効果の判定は試験開始後28日目に、左右の被験部位の毛髪各々20本ずつ剃毛し、左側の毛20本の長さの平均値(8)を

右側の毛20本の長さの平均値(A)で除した値を求めて評価した。(判定結果 被試験者10名の(B)/(A)の平均値)

以下に、実施例及び比較例の試験方法及び試験結果について示す。尚、以下に示す%とは重量%を意味する。

実施例1～8、比較例1～4

(1) 処方(ローション)

成 分	実施例 1	比較例 1	比較例 2	実施例 2	実施例 3	比較例 3	比較例 4
化合物A 部	1.0	1.0	—	5	0.5	—	1.0
オキセンドロン部	0.05	—	0.05	0.5	0.005	0.05	—
95%エタノール部	79.0	79.0	79.0	79.0	79.0	79.0	79.0
イオン交換水部	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量
ポリオキシエチレン 硬化ヒマシ油部	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
塩化カルプロニウム部	—	—	—	—	—	1.0	—
ビタミンA <sub>1</sub> 部	—	—	—	—	—	—	0.05

実施例4、比較例5～7

(1) 処方

成 分	実施例 4	比 較 例			対照例
		5	6	7	
化 合 物 A 部	0.05	0.05	—	—	—
オキセンドロン部	0.005	—	0.005	0.005	—
95%エタノール部	70	70	70	70	70
イオン交換水部	残量	残量	残量	残量	残量
ポリオキシエチレン 硬化ヒマシ油部	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
香 料 部	適量	適量	適量	適量	適量
塩化カルプロニウム部	—	—	—	0.05	—

(2) 試験

本品の養毛効果を健康な男子10名により、前記試験方法記載の「ヒト頭髪毛成長促進効果試験方法」により行なった。結果を第8表に示す。

(以下空白)

(2) 試験

上記試料を用いてマウス毛成長促進試験を実施した。その結果を第2表に示す。

第2表 マウス毛成長促進試験結果

試 料	毛 長 (mm)	毛 重 量 (mg)	評価点
1 実施例1	7.13	7.25	4.2
2 比較例1	5.58	5.45	3.1
3 比較例2	5.41	5.31	3.1
4 実施例2	7.32	7.46	4.3
5 実施例3	6.85	7.00	4.0
6 比較例3	5.85	5.60	3.2
7 比較例4	5.74	5.71	3.2

第2表から明らかなように、実施例1の毛長、毛重量はともに比較例より大きく、また肉眼判定による評価点も高い値を示し、本発明の毛成長促進効果が著しい事が認められる。

また、実施例2、実施例3においても、本発明の毛成長促進効果が著しい事がわかる。

第3表

試 料	(B) (A) 平均値
実施例5	1.30
比較例5	1.05
同上6	1.06
同上7	1.08

第3表から明らかな如く、本発明品の毛成長促進効果は著しいことが判明した。また更に、頭髪において皮脂の分泌とよけの生成を減少する事が認められた。

(以下空白)

実施例5、比較例8～10

第4表

(1) 処方

成 分	実施例 5	比 較 例			対照例
		8	9	10	
化 合 物 A 濃	0.5	0.5	—	—	—
オキセンドロン 濃	0.05	—	0.05	0.05	—
95%ニタノール濃	70	70	70	70	70
イオン交換水 濃	残量	残量	残量	残量	残量
ポリオキシエチレン 炭化ヒマシ油 濃	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
香 料 濃	適量	適量	適量	適量	適量
塩化カルプロニウム濃	—	—	—	0.5	—

試 料	(B) (A) 平均値
実施例6	1.85
比較例8	1.07
同上9	1.09
同上10	1.12

第4表から明らかな如く、本発明品の毛成長促進効果は著しいことが判明した。

特許出願人 達特株式会社

(2) 試験

本品の毛毛効果をもて型脱毛症患者5名により、前記試験方法で行なった。結果を第4表に示す。

(以下省略)